






# 1-(BENZOTHAZOL-2-YL)PYRAZOLE DERIVATIVES AND COX-2 INHIBITORS CONTAINING THE SAME

(40)

**Patent number:** WO0187880  
**Publication date:** 2001-11-22  
**Inventor:** AOTSUKA TOMOJI (JP); WAGATSUMA NAGATOSHI (JP); ISHITANI KOUKI (JP); KATO HIDEAKI (JP)  
**Applicant:** GRELAN PHARMACEUTICAL CO (JP); AOTSUKA TOMOJI (JP); WAGATSUMA NAGATOSHI (JP); ISHITANI KOUKI (JP); KATO HIDEAKI (JP)  
**Classification:**  
- **international:** C07D417/04; A61K31/428; A61P43/00; A61P29/00  
- **european:** A61K31/428; C07D417/04  
**Application number:** WO2001JP03940 20010511  
**Priority number(s):** JP20000141316 20000515

## Cited documents:

 US5242940  
 EP0155523  
 WO9727181  
 WO9606840  
 WO9603392  
more >>

[Report a data error here](#)

## Abstract of WO0187880

Anti-inflammatory drugs are provided, which are excellent in pharmacological effects and exhibit a selective COX-2-inhibitory activity expected to relieve the side effects including gastric mucosa disorders. Specifically, compounds of the general formula (1) or medicinally acceptable salts thereof; and COX-2 inhibitors containing the compounds or the salts, wherein R<1> is hydrogen, halogeno, lower alkyl, or lower alkoxy; R<2> is halogenated lower alkyl or lower alkyl; R<3> is lower alkyl; and n is an integer of 0 to 2.

---

Data supplied from the [esp@cenet](mailto:esp@cenet) database - Worldwide

(40)

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2001年11月22日 (22.11.2001)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 01/87880 A1(51) 国際特許分類:  
31/428, A61P 43/00, 29/00

C07D 417/04, A61K

(74) 代理人: 弁理士 水野昭宣 (MIZUNO, Akinobu); 〒150-0044 東京都渋谷区円山町22番12 ライオンズマンション渋谷道玄坂303 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/03940

(22) 国際出願日: 2001年5月11日 (11.05.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2000-141316 2000年5月15日 (15.05.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): グレラン製薬株式会社 (GRELAN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒205-8501 東京都羽村市栄町3丁目4番地3 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

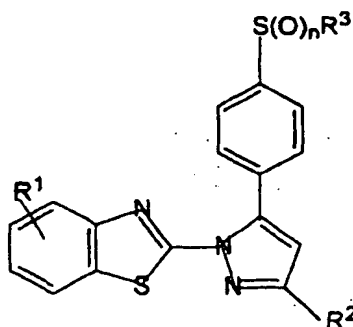
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 青塚知士 (AOTSUKA, Tomoji) [JP/JP]. 我妻永利 (WAGATSUMA, Nagatoshi) [JP/JP]. 石谷幸喜 (ISHITANI, Kouki) [JP/JP]. 加藤英明 (KATO, Hideaki) [JP/JP]; 〒205-8501 東京都羽村市栄町3丁目4番地3 グレランリサーチセンター内 Tokyo (JP).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 1-(BENZOTHAZOL-2-YL)PYRAZOLE DERIVATIVES AND COX-2 INHIBITORS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 1-(ベンゾチアゾール-2-イル)ピラゾール誘導体およびそれを含有するCOX-2阻害剤



(1)

(57) Abstract: Anti-inflammatory drugs are provided, which are excellent in pharmacological effects and exhibit a selective COX-2-inhibitory activity expected to relieve the side effects including gastric mucosa disorders. Specifically, compounds of the general formula (1) or medicinally acceptable salts thereof; and COX-2 inhibitors containing the compounds or the salts, wherein R<sup>1</sup> is hydrogen, halogeno, lower alkyl, or lower alkoxy; R<sup>2</sup> is halogenated lower alkyl or lower alkyl; R<sup>3</sup> is lower alkyl; and n is an integer of 0 to 2.

[続葉有]

WO 01/87880 A1